



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20190550 T1

HR P20190550 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

A61K 31/375 (2006.01)
A61K 31/185 (2006.01)
A61K 31/4402 (2006.01)
A61K 33/08 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/26 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61P 1/10 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.05.2019.

(21) Broj predmeta: P20190550T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 20.03.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/IB2013001640
Datum podnošenja međunarodne prijave: 26.07.2013.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 13822195.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 26.07.2013.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2014016671
Datum međunarodne objave: 30.01.2014.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2877163 A2
Datum objave europske prijave patenta: 03.06.2015.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2877163 B1
Datum objave europskog patenta: 20.03.2019.

(31) Broj prve prijave: 201261676608 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 27.07.2012. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

Redhill Biopharma Ltd., 21 Ha'arba'a Street, Tel-Aviv 64739, IL

(72) Izumitelji:

Reza Fathi, 260 Forest Avenue, Oradell, NJ 07649, US

Patrick Laughlin McLean, 911/3480 Rue Simpson, Montreal, QC H3G 2N7, CA

(74) Zastupnik:

CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

**FORMULE I METODE PROIZVODNJE FORMULACIJA ZA UPOTREBU U PRAŽNJENJU
DEBELOG CRIJEVA**

HR P20190550 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Metoda proizvodnje čvrste dozirne formulacije sa sljedećim elementima:
 - (i) barem jedno mokro granulirajuće osmotsko sredstvo za pražnjenje, barem jedan antacid i prva farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari koja tvori intragranularnu frakciju, pri čemu je barem jedno osmotsko sredstvo za pražnjenje natrijev pikosulfat i barem je jedan antacid magnezijev oksid;
 - (ii) miješanje intragranularne frakcije dobivene korakom (i) s elementima ekstragranularne frakcije koja se sastoji od jedne ili više organskih kiselina, nemetalnog elementa za podmazivanje i druge farmaceutski prihvatljive komponente pomoćne tvari, pri čemu je barem jedna organska kiselina askorbinska kiselina i nemetalno sredstvo za podmazivanje jest ester masnih kiselina; i pri čemu je moguće uključiti sredstvo za raspadanje, koje je unakrsno povezani povidon; i
 - (iii) stiskanje mješavine dobivene korakom (ii) u tablete.
2. Metoda iz zahtjeva 1., pri čemu je natrijev pikosulfat mikronizirani natrijev pikosulfat.
3. Metoda iz zahtjeva 1. ili zahtjeva 2., pri čemu intragranularna frakcija čini 50 % ukupne težine formulacije i pri čemu ekstragranularna frakcija čini 50 % ukupne težine formulacije.
4. Metoda iz zahtjeva 1. ili zahtjeva 2., pri čemu prva farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari ili druga farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari uključuje barem jedno od vezivnog sredstva, razrjeđivača, stabilizatora, sredstva za raspadanje, sredstva protiv pjenjenja ili sredstva protiv prljanja.
5. Metoda iz zahtjeva 1. ili zahtjeva 2., pri čemu prva farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari uključuje prvu količinu razrjeđivača, a druga farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari uključuje drugu količinu istoga razrjeđivača tako da je razrjeđivač u formulaciji ravnomjerno raspodijeljen između intragranularne frakcije i ekstragranularne frakcije.
6. Metoda iz zahtjeva 1. ili zahtjeva 2., pri čemu barem jedna komponenta osmotskog sredstva za pražnjenje u intragranularnoj frakciji čini do 1 % ukupne težine formulacije; ili pri čemu barem jedna komponenta antacida u intragranularnoj frakciji čini do 20 % ukupne težine formulacije.
7. Metoda iz zahtjeva 1. ili zahtjeva 2., pri čemu prva farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari čini do 30 % ukupne težine formulacije; ili pri čemu druga farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari čini do 10 % ukupne težine formulacije.
8. Metoda iz zahtjeva 1. ili zahtjeva 2., pri čemu jedna ili više organskih kiselina u ekstragranularnoj frakciji čini do 40 % ukupne težine formulacije; ili pri čemu nemetalni element za podmazivanje u ekstragranularnoj frakciji čini do 3 % ukupne težine formulacije.
9. Metoda iz zahtjeva 1. ili zahtjeva 2. sa sljedećim elementima:
 - (iv) premazivanje tableta.
10. Čvrsta dozirna formulacija sa sljedećim elementima:
 - intragranularna frakcija pomiješana s ekstragranularnom frakcijom, pri čemu intragranularna frakcija uključuje granule koje se sastoje od barem jednoga osmotskog sredstva za pražnjenje, barem jednoga antacida i prve farmaceutski prihvatljive komponente pomoćne tvari; i pri čemu ekstragranularna frakcija uključuje jednu ili više organskih kiselina, nemetalno sredstvo za podmazivanje i drugu farmaceutski prihvatljivu komponentu pomoćne tvari; pri čemu je barem jedno osmotsko sredstvo za pražnjenje natrijev pikosulfat; pri čemu je barem jedan antacid magnezijev oksid; pri čemu je barem jedna organska kiselina askorbinska kiselina; pri čemu je nemetalno sredstvo za podmazivanje ester masnih kiselina; i pri čemu je moguće uključiti sredstvo za raspadanje, koje je unakrsno povezani povidon.
11. Formulacija iz zahtjeva 10., pri čemu je natrijev pikosulfat mikronizirani natrijev pikosulfat.
12. Formulacija iz zahtjeva 10. ili 11., pri čemu intragranularna frakcija čini 50 % ukupne težine formulacije i pri čemu ekstragranularna frakcija čini 50 % ukupne težine formulacije.
13. Formulacija iz zahtjeva 10. ili 11., pri čemu prva farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari ili druga farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari uključuje barem jedno od vezivnog sredstva, razrjeđivača, stabilizatora, sredstva za raspadanje, sredstva protiv pjenjenja ili sredstva protiv prljanja; ili pri čemu prva farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari uključuje prvu količinu razrjeđivača, a druga farmaceutski prihvatljiva komponenta pomoćne tvari uključuje drugu količinu istoga razrjeđivača tako da je razrjeđivač u formulaciji ravnomjerno raspodijeljen između intragranularne frakcije i ekstragranularne frakcije, neobavezno, pri čemu se razrjeđivač bira iz jedne ili kombinacije laktoze monohidrata, mikrokristalične celuloze ili sorbitola.
14. Formulacija iz zahtjeva 10. ili 11. u obliku tablete, kapsule, pastile, pilule; ili dvoslojne tablete, kapsule, pastile ili pilule.
15. Tableta za uporabu u metodi pražnjenja debeloga crijeva bolesnika, pri čemu tableta uključuje intragranularnu frakciju pomiješanu s ekstragranularnom frakcijom, pri čemu intragranularna frakcija uključuje granule koje se sastoje od natrijeva pikosulfata, magnezijeva oksida, simetikona i prve farmaceutski prihvatljive komponente pomoćne tvari,

pri čemu ekstragranularna frakcija uključuje askorbinsku kiselinu i drugu farmaceutski prihvatljivu komponentu pomoćne tvari, i

pri čemu metoda uključuje, unutar razdoblja od 24 sata, oralno davanje bolesniku 25 do 30 tableta s tekućinom, iz čega proizlazi ukupna doza od otprilike 30 mg natrijeva pikosulfata, otprilike 7 g magnezijeva oksida, otprilike 15 g askorbinske kiseline i otprilike 100 mg simetikona.

5

16. Čvrsta dozirna formulacija prema zahtjevu 10. ili 11. za uporabu u metodi pražnjenja debelog crijeva bolesnika.